

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
10. Februar 2005 (10.02.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2005/012302 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: **C07D 473/00**, A61K 31/52, A61P 31/12

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/008197

(22) Internationales Anmeldedatum:
22. Juli 2004 (22.07.2004)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
103 35 061.6 31. Juli 2003 (31.07.2003) DE

(71) Anmelder (*für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US*): WACKER-CHEMIE GMBH [DE/DE]; Hanns-Seidel-Platz 4, 81737 München (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (*nur für US*): DÖRING, Wolfgang [DE/DE]; Angelmannstrasse 11, 84561 Mehring (DE). PETERSEN, Hermann [DE/DE]; Karl-Gros-Strasse 11, 84489 Burghausen (DE).

(74) Anwälte: POTTEN, Holger usw.; c/o Wacker-Chemie GmbH, Hanns-Seidel-Platz 4, 81737 München (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (*soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart*): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (*soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart*): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

- mit internationalem Recherchenbericht
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen

Zur Erklärung der Zwei-Buchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

WO 2005/012302 A1

(54) **Title:** METHOD FOR THE PRODUCTION OF OH PROTECTED [4-(2,6-DIAMINO-9H-PURINE-9-YL)- 1,3-DIOXOLANE-2-YL]METHANOL DERIVATIVES

(54) **Bezeichnung:** VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG VON OH-GESCHÜTZTEN [4-(2,6-DIAMINO-9H-PURIN-9-YL)- 1,3-DIOXOLAN-2-YL]METHANOL-DERIVATEN

(57) **Abstract:** The invention relates to a method for the production of OH protected [4-(2,6-diamino-9H-purine-9-yl)-1,3-dioxolane-2- yl]methanol derivatives in a racemically or optically pure form by directly reacting 2,6-diaminopurine and/or a single or multiple silylated 2,6-diaminopurine with a sugar component. An auxiliary agent in the form of a 1,3- dicarbonyl compound or a silylated derivative of a 1,3 dicarbonyl compound is present during the reaction of the glycosylation, in addition to a Lewis acid.

(57) **Zusammenfassung:** Die Erfindung betrifft ein Verfahren zur Herstellung von OH- geschützten [4-(2,6-diamino-9H-purin-9-yl)-1,3-dioxolan-2- yl]methanol-Derivaten in racemischer oder optisch reiner Form durch direkte Umsetzung von 2,6-Diaminopurin bzw. eines ein- oder mehrfach silylierten 2,6-Diaminopurins mit einem Zuckerbaustein, wobei bei der Glycosylierungsreaktion neben einer Lewis-Säure ein Hilfsstoff in Form einer 1,3- Dicarbonylverbindung oder eines silylierten Derivates einer 1,3-Dicarbonylverbindung zugegen ist.